

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
4. Dezember 2003 (04.12.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 03/099009 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A01N 43/54**,  
43/78, 43/80, C07D 417/12, 413/12, 409/12, 405/12,  
401/12, A01N 43/76

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/05160

(22) Internationales Anmeldedatum:  
16. Mai 2003 (16.05.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 23 914.2 29. Mai 2002 (29.05.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-  
SELLSCHAFT** [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789  
Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **SCHWARZ**,  
Hans-Georg [DE/DE]; Heinenbusch 19e, 40764  
Langenfeld (DE). **ANDREE, Roland** [DE/DE];  
Dechant-Miebach-Weg 37, 40764 Langenfeld (DE).  
**HOISCHEN, Dorothee** [DE/DE]; Hortensienstr. 31,  
40474 Düsseldorf (DE). **LINKER, Karl-Heinz** [DE/DE];  
Kurt-Schumacher-Ring 56, 51377 Leverkusen (DE).  
**DREWES, Mark, Wilhelm** [DE/DE]; Goethestr. 38,  
40764 Langenfeld (DE). **DAHMEN, Peter** [DE/DE];  
Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss (DE). **FEUCHT**,  
Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, 40789 Monheim (DE).  
**PONTZEN, Rolf** [DE/DE]; Am Kloster 69, 42799 Leich-  
lingen (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER CROPSCIENCE  
AKTIENGESELLSCHAFT**; Legal & Patents, Patents  
and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Erklärungen gemäß Regel 4.17:**

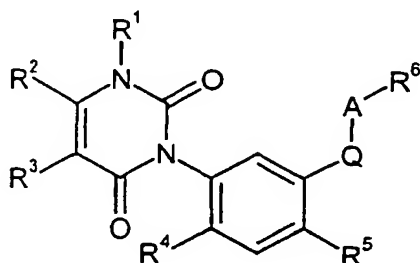
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu  
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die  
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,  
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,  
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK,  
SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW. ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,  
IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent  
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG)

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität  
einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17  
Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SUBSTITUTED PHENYLURACILS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PHENYLURACILE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel substituted  
phenyluracils of general formula (I) wherein A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>,  
R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> have the designation cited in the descrip-  
tion, to a method for producing said phenyluracils, and to  
the use of the same as plant treating agents.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue sub-  
stituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I); in wel-  
cher A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die in der Beschreibung  
angegebene Bedeutung haben, Verfahren zu ihrer Herstel-  
lung und deren Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel.

BEST AVAILABLE COPY

WO 03/099009 A1

WO 03/099009 A1



**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

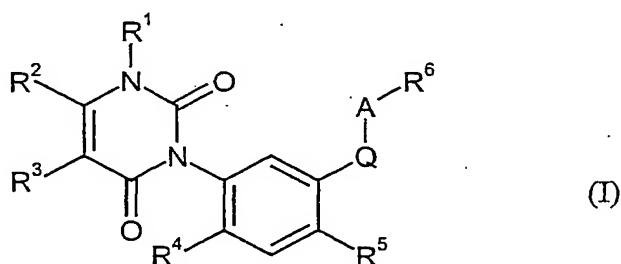
*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

### Substituierte Phenyluracile

Die Erfindung betrifft neue substituierte Phenyluracile, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel, insbesondere als Herbizide.

Bestimmte substituierte Phenyluracile, die eine den Verbindungen der vorliegenden Erfindung ähnliche Struktur aufweisen, sind bereits bekannt (z.B. EP-A-255 047, EP-A-831 091, EP-A-1 061 075, US-6,207,830). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt, weil sie verschiedene Nachteile aufweisen.

Es wurden nun neue substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I)



in welcher

A für Alkandiyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO<sub>2</sub> steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

- R<sup>2</sup> für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,
- 5 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder Halogen steht,
- 10 R<sup>5</sup> für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und
- 15 R<sup>6</sup> für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy-carbonyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Cyano-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, Carboxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls
- 20 zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocyclyl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen, ausgewählt aus bis zu 5 Stickstoffatomen
- 25 und/oder bis zu 2 Sauerstoffatomen und/oder bis zu 2 Schwefelatomen sowie
- 30

gegebenenfalls mit zusätzlich bis zu 2 -SO-Gruppen, bis zu 2 -SO<sub>2</sub>-Gruppen,  
bis zu 2 -CO-Gruppen oder bis zu 2 -CS-Gruppen steht,

einschließlich der möglichen stereoisomeren Formen

5

gefunden.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkenyl - auch  
in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder ver-  
zweigt.

10

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein;  
wobei bei Mehrfachsubstitution die Substituenten gleich oder verschieden sein  
können.

15

Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufge-  
führten Formeln vorhandenen Reste werden wie folgt definiert:

20

A steht bevorzugt für Alkandiyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2  
bis 5 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen.

Q steht bevorzugt für O (Sauerstoff), S (Schwefel) oder SO<sub>2</sub>.

25

R<sup>1</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano,  
Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff-  
atomen.

30

R<sup>2</sup> steht bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils  
gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl  
oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-  
gruppen.

- R<sup>3</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.
- 5 R<sup>4</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder Iod.
- R<sup>5</sup> steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder  
10 jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.
- R<sup>6</sup> steht bevorzugt für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch  
15 Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Alkenyloxy-carbonyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils ge-  
20 gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyl, Cyano-C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkenyl, Carboxy-C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gege-  
25 benenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) sub-  
stituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocyclyl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen ausgewählt aus bis zu 3 Stick-  
stoffatomen und/oder einem Sauerstoffatom und/oder einem Schwefelatom,  
30 sowie gegebenenfalls mit zusätzlich einer -SO-Gruppe, einer -SO<sub>2</sub>-Gruppe, einer -CO-Gruppe oder einer -CS-Gruppe.

- A steht besonders bevorzugt für Alkandiyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen.
- 5 Q steht besonders bevorzugt für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel).
- R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder i-Propyl.
- 10 R<sup>2</sup> steht besonders bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
- 15 R<sup>3</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder i-Propyl.
- 20 R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor oder Brom.
- R<sup>5</sup> steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen.
- 25 R<sup>6</sup> steht besonders bevorzugt für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)-
- 30

- amino-carbonyl oder N-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy-carbonyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, 5 Cyano-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkenyl, Carboxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Benzopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrazolyl, 10 Benzopyrazolyl, Pyrazolinyl, Imidazolyl, Benzimidazolyl, Imidazolinyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Oxazolinyl, Isoxazolyl, Isoxazolinyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Thiazolinyl, Thiadiazolyl, Triazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, 15 Triazinyl.
- A steht ganz besonders bevorzugt für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,1-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,1-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin- 20 1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl.
- Q steht ganz besonders bevorzugt für O (Sauerstoff).
- R<sup>1</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl. 25
- R<sup>2</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thio-carbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxy-carbonyl. 30



R<sup>3</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl.

R<sup>4</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor oder Chlor.

R<sup>5</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.

R<sup>6</sup> steht ganz besonders bevorzugt für über ein Kohlenstoffatom mit A. verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Cyclopentyloxycarbonyl, Cyclohexyloxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl oder N-Methoxy-methylaminocarbonyl, oder durch Propenyloxycarbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind), oder durch Cyanomethyl, Cyanoethyl, Cyanopropyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, n- oder i-Propoxycarbonylmethyl, Methoxycarbonyl-ethyl, Ethoxycarbonylethyl, n- oder i-Propoxycarbonylethyl, Cyanoethenyl, Cyanopropenyl, Carboxyethenyl, Carboxypropenyl, Methoxycarbonyl-ethenyl, Ethoxycarbonylethenyl, n- oder i-Propoxycarbonylethenyl, Methoxycarbonylpropenyl, Ethoxycarbonylpropenyl, n- oder i-Propoxycarbonylpropenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-

oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind) substituiertes Heterocycl aus der Reihe Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrazolyl, Pyrazolinyl, Imidazolyl, Imidazolinyl, Oxazolyl, Oxazolinyl, Isoxazolyl, Isoxazolinyl, Thiazolyl, Thiazolinyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl.

A steht am meisten bevorzugt für Methylen.

10 R<sup>1</sup> steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Amino.

R<sup>2</sup> steht am meisten bevorzugt für Trifluormethyl.

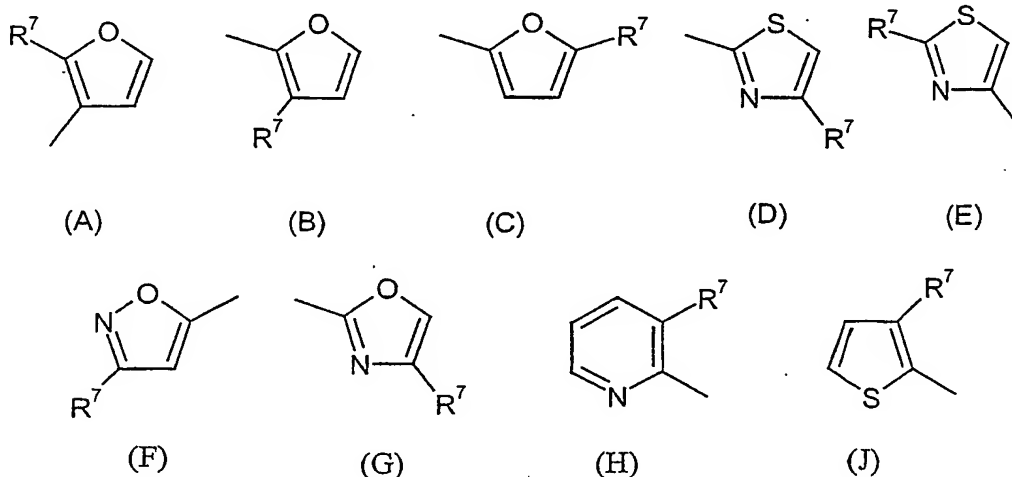
R<sup>3</sup> steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff.

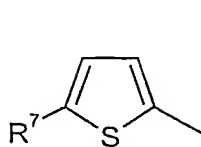
15

R<sup>4</sup> steht am meisten bevorzugt für Fluor.

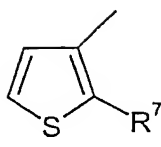
R<sup>5</sup> steht am meisten bevorzugt für Chlor, Brom oder Cyano.

20 R<sup>6</sup> steht am meisten bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen (A) bis (L)





(K)



(L)

worin

5  $R^7$  für Carboxy, Carbamoyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder n- oder i-Propoxycarbonyl steht.

$R^7$  steht bevorzugt für Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl.

10 Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

15 Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

20 Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als am meisten bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

25 Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

A für Methylen steht,

Q für O (Sauerstoff) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

5 R<sup>2</sup> für Cyano oder Trifluormethyl steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

10 R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R<sup>5</sup> für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

15 R<sup>6</sup> für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Furyl steht.

20 Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

A für Methylen steht,

25 Q für O (Sauerstoff) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Cyano oder Trifluormethyl steht,

30 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R<sup>5</sup> für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

5 R<sup>6</sup> für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Oxazolyl steht.

10

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

A für Methylen steht,

15

Q für O (Sauerstoff) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

20

R<sup>2</sup> für Cyano oder Trifluormethyl steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

25

R<sup>5</sup> für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

R<sup>6</sup> für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy,

30

Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Isoxazolyl steht.

5 Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

A für Methylen steht,

10 Q für O (Sauerstoff) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Cyano oder Trifluormethyl steht,

15 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

20 R<sup>5</sup> für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

R<sup>6</sup> für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder  
25 Ethylsulfonyl substituiertes Thiazolyl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

30 A für Methylen steht,

Q für O (Sauerstoff) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

5 R<sup>2</sup> für Cyano oder Trifluormethyl steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

10

R<sup>5</sup> für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

R<sup>6</sup> für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxy-  
carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zu-  
15 sätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy,  
Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder  
Ethylsulfonyl substituiertes Pyridinyl steht.

15

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der  
20 Formel (I) in welcher

20

A für Methylen steht,

Q für O (Sauerstoff) steht,

25

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Cyano oder Trifluormethyl steht,

30

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R<sup>5</sup> für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

5 R<sup>6</sup> für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Thienyl steht.

10

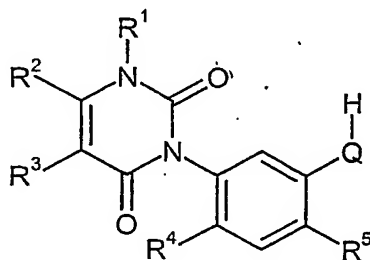
Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

15

Die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

20

Man erhält die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I), wenn man Hydroxyphenyl- oder Mercaptophenyluracile der allgemeinen Formel (II)



(II)

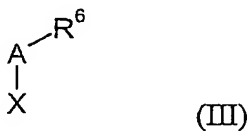
in welcher

25

Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,



mit substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (III)



5

in welcher

A und R<sup>6</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben und

10 X für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy steht,

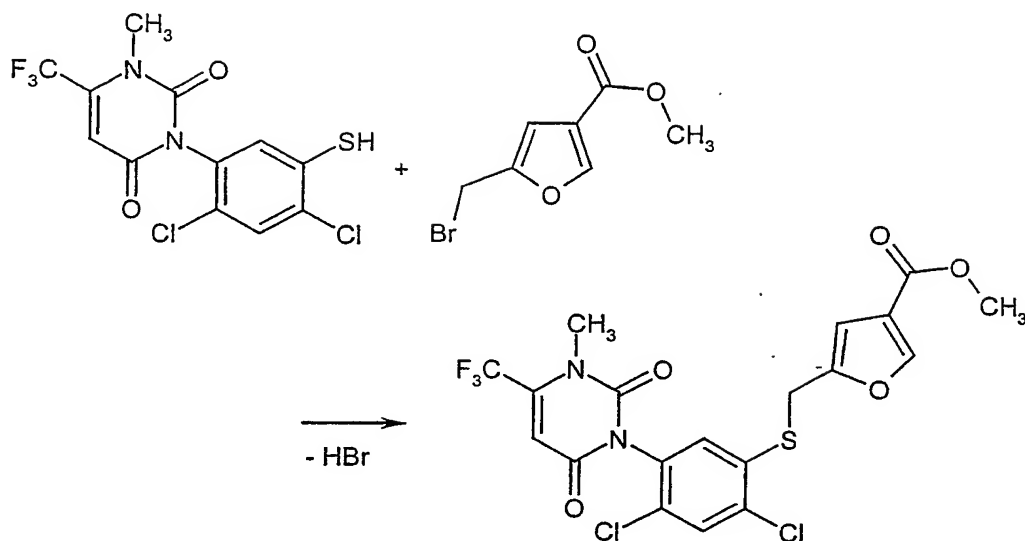
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

15

und gegebenenfalls die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) umwandelt.

20

Verwendet man beispielsweise 3-(2,4-Dichlor-5-mercapto-phenyl)-1-methyl-6-trifluormethyl-1H-pyrimidin-2,4-dion und 2-Brommethyl-furan-4-carbonsäure-methylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Hydroxyphenyl- und Mercapto-  
 5 phenyluracile sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. WO 97/01541, WO 98/54155).

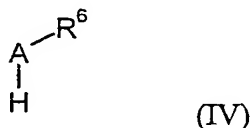
Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Heterocyclen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben A und R<sup>6</sup> vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für A und R<sup>6</sup> angegeben worden sind; X steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, Iod, gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyloxy

oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Methyl substituiertes Phenylsulfonyloxy, insbesondere für Chlor, Brom, Methylsulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Tolylsulfonyloxy.

5 Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. J. Chem. Soc., Chem. Commun. 19 (1996), 2251-2252; J. Med. Chem. 38 (1995), 4806-4820; Tetrahedron 54 (1998), 7525-7538; Dokl. Akad. Nauk. Arm. SSR 17 (1953), 97-103; Organic Process Research & Development 5 (2001), 37-44).

10

Man erhält die substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (III), wenn man beispielsweise Alkylheterocyclen der allgemeinen Formel (IV)



15

in welcher

A und R<sup>6</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Halogenierungsmitteln, wie z.B. N-Brom-succinimid oder N-Chlor-succinimid, vorzugsweise in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. 2,2'-Azobis-2-methyl-propannitril, und vorzugsweise in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrachlormethan, bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

25

Die substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (IV) sind bekannte organische Syntheschemikalien.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im Allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2.2.2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-en (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-ke-ton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid,

N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäße Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im Allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im Allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise Verbindungen, bei denen R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht, in entsprechende Verbindungen, bei denen R<sup>1</sup> für Amino steht, durch Umsetzung mit geeigneten Aminierungsmitteln, wie z.B. 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol (vgl. Herstellungsbeispiel) oder in entsprechende Verbindungen, bei denen R<sup>1</sup> für Methyl

steht, durch Umsetzung mit Dimethylsulfat oder Methylbromid (vgl. Herstellungsbeispiel).

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliant, Desiccant, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, 15 Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, 20 Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

25

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, 30 Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

5 Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuss-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

20 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

30 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie er-

wünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba- ren oder nicht schützba- ren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.



Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängeln; als Emulgier- und/oder schaum-erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

5

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern („Safenern“) zur Unkrautbekämpfung verwendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

15

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

20

Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim (-sodium), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Beflubutamid, Benazolin (-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-

25

don (-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop (-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-methyl), Cloransulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Diethatyl (-ethyl), Difenzoquat,

30

Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr,

Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron (-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop (-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazon (-sodium), Flufenacet, 5 Flufenpyr, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpysulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl), Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-methyl), Fluthi-  
amide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammonium), Glyphosate (-iso-  
propylammonium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxyethyl, -P-methyl), Hexazinone, 10 Imazamethabenz (-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Ketospiradox, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-) Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron (-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Penoxysulam, Pentoxazone, Pethoxamid, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, 20 Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Profluazol, Profoxydim, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazon (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl), Pyriithiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazon, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tio-  
carbrazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tri-  
diphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

Für die Mischungen kommen weiterhin bekannte Safener in Frage, beispielsweise AD-67, BAS-145138, Benoxacor, Cloquintocet (-mexyl), Cyometrinil, 2,4-D, DKA-24, Dichlormid, Dymron, Fencloirim, Fenchlorazol (-ethyl), Flurazole, Fluxofenim, 5 Furilazole, Isoxadifen (-ethyl), MCPA, Mecoprop (-P), Mefenpyr (-diethyl), MG-191, Oxabetrinil, PPG-1292, R-29148.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzen- 10 nährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen; wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt 15 werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden einge- 20 arbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Boden- 25 fläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vor- 30 kommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene

Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden, gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

5

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften ("Traits"), die durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese, oder auch durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

10

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel - auch in Kombination mit anderen agrochemischen Wirkstoffen, besseres Wachstum der Kulturpflanzen, erhöhte Toleranz der Kulturpflanzen gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz der Kulturpflanzen gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

15

20

25

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit

30

oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obst-  
10 pflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die  
15 Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden "Bt Pflanzen" genannt). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine,  
20 Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinothricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden  
25 Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel)  
30 vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid-tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen

Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinothricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid-resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel I bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden, wobei zusätzlich zu der guten Bekämpfung der Unkrautpflanzen die oben genannten synergistischen Effekte mit den transgenen Pflanzen oder Pflanzensorten auftreten. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

5

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungs-minderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

15

20

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.

25

30

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt

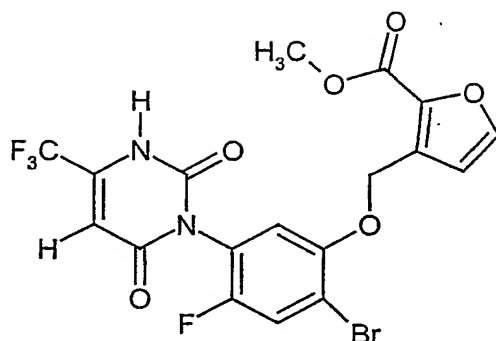


oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

5 Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien  
10 wirksam.

Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel-  
15 und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus  
20 den nachfolgenden Beispielen hervor.

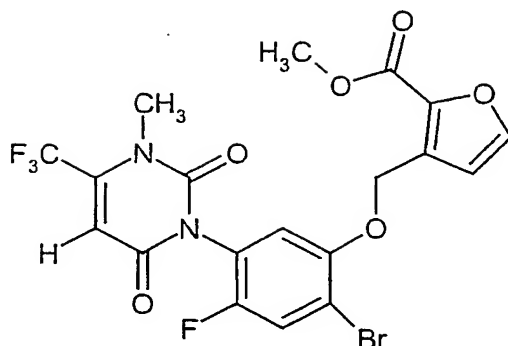
**Herstellungsbeispiele:****Beispiel 1**

5

Eine Mischung aus 7,50 g (20,3 mMol) 3-(4-Brom-2-fluor-5-hydroxy-phenyl)-6-trifluormethyl-1H-pyrimidin-2,4-dion; 4,45 g (20,3 mMol) 3-Brommethyl-furan-2-carbonsäure-methylester, 5,6 g (40,6 mMol) Kaliumcarbonat und 120 ml Acetonitril wird 6 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird die Mischung auf etwa die gleiche Volumenmenge 2N-Salzsäure gegossen und mit Essigsäureethylester geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeeengt und der Rückstand säulenchromatografisch (Kieselgel, Methylenchlorid/Essigsäureethylester, Vol.: 95/5) aufgearbeitet.

15

Man erhält 5,80 g (55 % der Theorie) 3-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxy-methyl]-furan-2-carbonsäure-methylester.

Beispiel 2

(Folgeumsetzung)

5

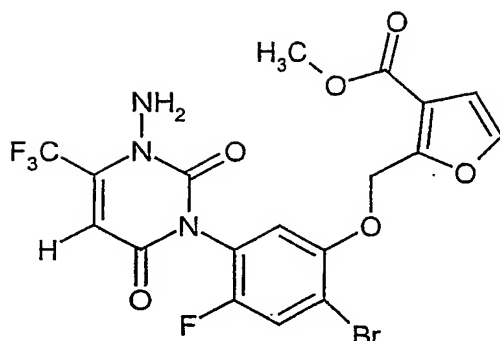
Eine Mischung aus 2,50 g (4,93 mMol) 3-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxy-methyl]-furan-2-carbonsäure-methylester, 0,82 g (5,92 mMol) Kaliumcarbonat und 65 ml Acetonitril wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) 10 Minuten gerührt und dann mit einer Lösung von 0,75 g (5,92 mMol) Dimethylsulfat in 5 ml Acetonitril unter Rühren tropfenweise versetzt. Die Reaktionsmischung wird dann 2 Stunden bei 45°C gerührt, anschließend auf etwa die doppelte Menge Wasser gegossen und mit Methylenchlorid geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeeengt, der Rückstand mit Hexan verrührt und das kristallin anfallende Produkt durch Absaugen isoliert.

15

Man erhält 2,2 g (79 % der Theorie) 3-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-3-methyl-4-trifluoromethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxy-methyl]-furan-2-carbonsäure-methylester.

20

LogP (pH 2,3) = 3,34.

Beispiel 3

(Folgeumsetzung)

5

Eine Mischung aus 2,50 g (4,93 mMol) 2-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxy-methyl]-furan-3-carbonsäure-methylester, 0,50 g (5,92 mMol) Natriumhydrogencarbonat und 50 ml N,N-Dimethyl-formamid wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) 10 Minuten gerührt und dann mit 1,18 g (5,92 mMol) 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol innerhalb von 6 Stunden - auf kleine Portionen aufgeteilt - versetzt. Die Reaktionsmischung wird 15 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann werden weitere 0,60 g 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol dazu gegeben und die Mischung wird weitere 15 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird auf etwa das doppelte Volumen Wasser gegossen und dann mit Essigsäureethylester geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeeengt und der Rückstand säulenchromatografisch (Kieselgel, Hexan/Essigsäureethylester, Vol.: 2/1) aufgearbeitet.

15

20

Man erhält 1,0 g (39 % der Theorie) 2-[2-Brom-5-(3-amino-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxy-methyl]-furan-3-carbonsäure-methylester.

LogP (pH 2,3) = 3,00.

25

Analog zu den Beispielen 1 bis 3 und entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

5

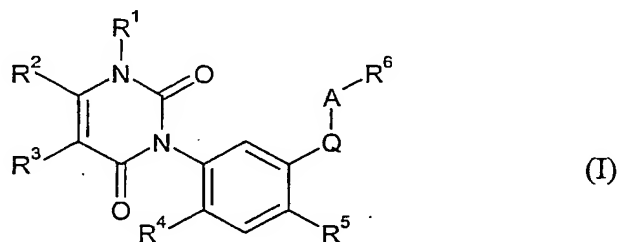
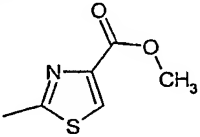
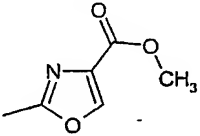
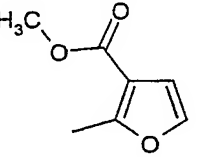
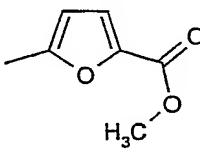
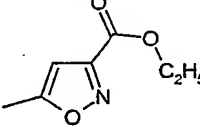
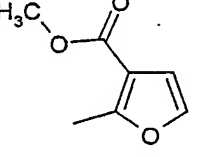
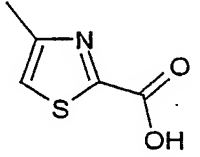
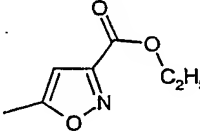
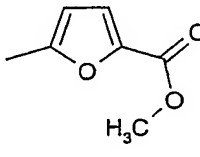
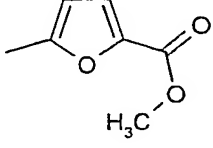
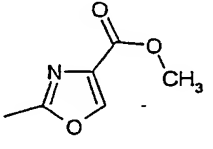
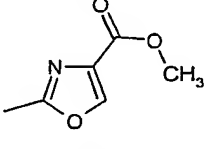
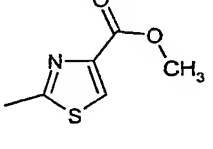
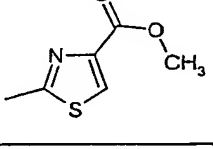
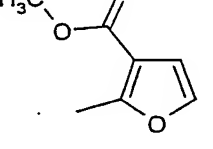
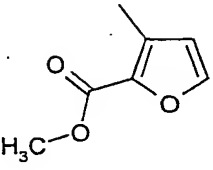
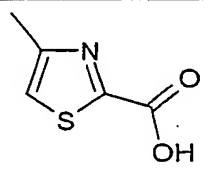
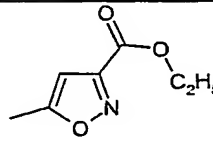
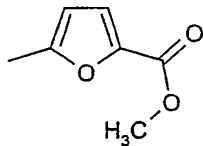
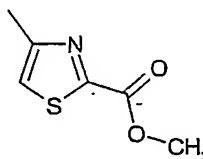
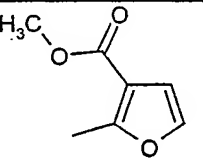
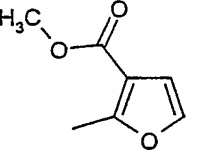
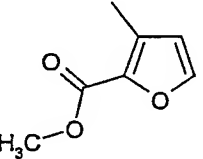
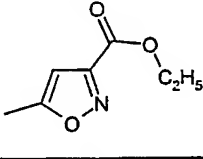
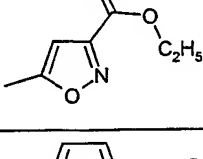
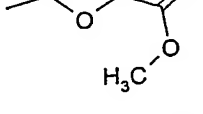


Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

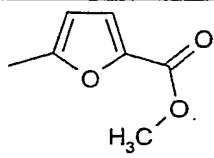
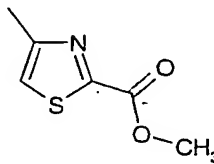
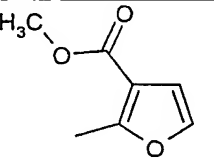
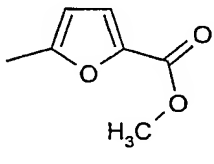
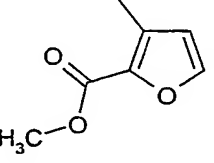
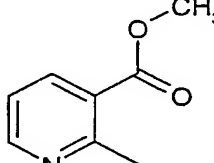
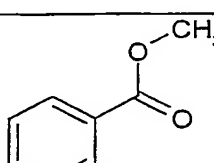
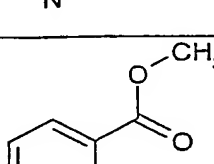
| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | Physikal.<br>Daten |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------------|
| 4            | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |                |                    |
| 5            | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |                | logP = 2,77<br>a)  |
| 6            | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |                | logP = 2,47<br>a)  |
| 7            | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |                | logP = 2,97<br>a)  |
| 8            | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |                | logP = 2,68<br>a)  |

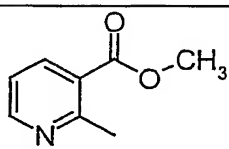
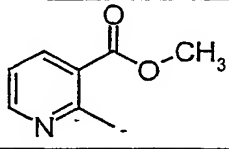
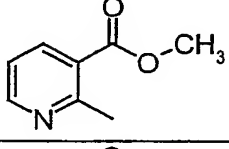
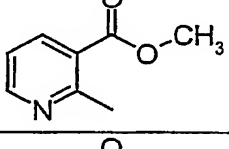
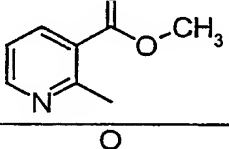
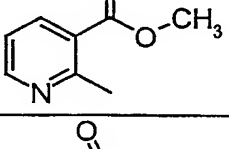
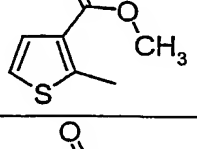
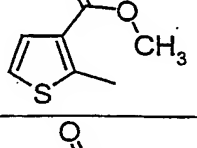
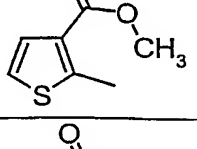
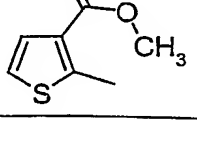
| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | Physikal.<br>Daten |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|--------------------|
| 9            | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    |                    |
| 10           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    |                    |
| 11           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    | logP = 2,73<br>a)  |
| 12           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |   | logP = 2,64<br>a)  |
| 13           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  |                    |
| 14           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  | logP = 3,32<br>a)  |
| 15           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  |                    |
| 16           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  | logP = 3,34<br>a)  |
| 17           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  | logP = 2,88<br>a)  |

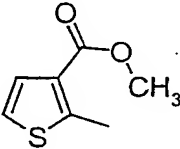
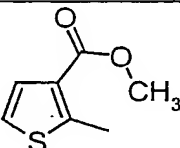
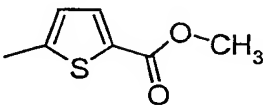
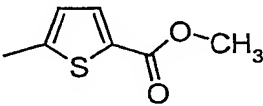
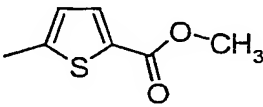
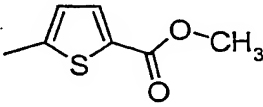
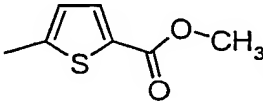
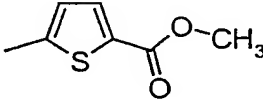
| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | Physikal.<br>Daten |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|--------------------|
| 18           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    | logP = 3,20<br>a)  |
| 19           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    | logP = 2,39<br>a)  |
| 20           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    | logP = 2,67<br>a)  |
| 21           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |   | logP = 2,61<br>a)  |
| 22           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 2,90<br>a)  |
| 23           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  |                    |
| 24           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 2,67<br>a)  |
| 25           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  |                    |
| 26           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 2,73<br>a)  |

| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | Physikal.<br>Daten |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|--------------------|
| 27           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    | logP = 2,58<br>a)  |
| 28           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    | logP = 3,09<br>a)  |
| 29           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    | logP = 3,27<br>a)  |
| 30           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |   | logP = 2,94<br>a)  |
| 31           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 3,26<br>a)  |
| 32           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 2,98<br>a)  |
| 33           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 3,28<br>a)  |
| 34           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 2,82<br>a)  |



| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | Physikal.<br>Daten |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|--------------------|
| 35           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    |                    |
| 36           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    | logP = 3,00<br>a)  |
| 37           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |    | logP = 2,91<br>a)  |
| 38           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |   | logP = 2,79<br>a)  |
| 39           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |  | logP = 2,89a)      |
| 40           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  |                    |
| 41           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  | logP = 1,62a)      |
| 42           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |  |                    |

| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | Physikal.<br>Daten        |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|---------------------------|
| 43           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    |                           |
| 44           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    |                           |
| 45           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    |                           |
| 46           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    | logP = 2,61 <sup>a)</sup> |
| 47           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |   |                           |
| 48           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | CN             |  |                           |
| 49           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  |                           |
| 50           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 3,71 <sup>a)</sup> |
| 51           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |  | logP = 3,36 <sup>a)</sup> |
| 52           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  |                           |

| Bsp.-<br>Nr. | A               | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | Physikal.<br>Daten        |
|--------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|---------------------------|
| 53           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    | logP = 3,80 <sup>a)</sup> |
| 54           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |    | logP = 3,44 <sup>a)</sup> |
| 55           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    |                           |
| 56           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |    | logP = 4,45 <sup>a)</sup> |
| 57           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Cl             |   | logP = 3,13 <sup>a)</sup> |
| 58           | CH <sub>2</sub> | O | H               | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  |                           |
| 59           | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  | logP = 3,52 <sup>a)</sup> |
| 60           | CH <sub>2</sub> | O | NH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | H              | F              | Br             |  |                           |

Die Bestimmung der in der Tabelle angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit a) markiert.

5 (b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

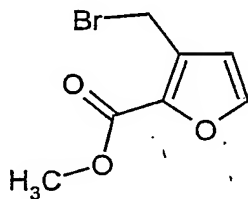
10 Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

15 Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

### Ausgangsstoffe der Formel (III):

#### Beispiel III-1

20



25 Eine Mischung aus 26,0 g (185,5 mMol) 3-Methyl-furan-2-carbonsäure-methylester, 33,0 g (185,5 mMol) N-Brom-succinimid (NBS), einer Spatelspitze 2,2'-Azobis-2-methyl-propannitril und 150 ml Tetrachlormethan wird 15 Stunden unter Rückfluß erhitzt und anschließend filtriert. Das Filtrat wird durch Destillation unter vermindertem Druck aufgearbeitet.

Man erhält 24,7 g (50 % der Theorie) 3-Brommethyl-furan-2-carbonsäure-methylester.

Siedebereich: 62-64°C (0,1 Torr).

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

## 5      Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Älkylarylpolglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, dass die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

25                      0 % =      keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
                         100 % =      totale Vernichtung

30      In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2, 3, 5, 6, 14, 17, 18, 19, 28, 29, 30, 31, 34, 35 und 36 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, Soja und Weizen, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

Beispiel B

## Post-emergence-Test

- 5      Lösungsmittel:      5 Gewichtsteile Aceton  
Emulgator:      1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

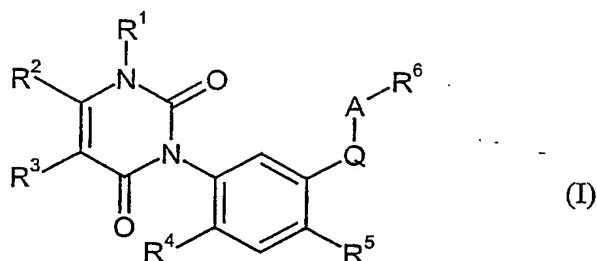
20      Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.  
Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
100 % = totale Vernichtung

25      In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 14, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35 und 36 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Weizen und Zuckerrüben, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

### Patentansprüche

#### 1. Verbindungen der Formel (I)



in welcher

A für Alkandiyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO<sub>2</sub> steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R<sup>2</sup> für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,



R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder Halogen steht,

R<sup>5</sup> für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und

R<sup>6</sup> für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy-carbonyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Cyano-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, Carboxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocycl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen, ausgewählt aus bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder bis zu 2 Sauerstoffatomen und/oder bis zu 2 Schwefelatomen sowie gegebenenfalls mit zusätzlich bis zu 2 -SO-Gruppen, bis zu 2 -SO<sub>2</sub>-Gruppen, bis zu 2 -CO-Gruppen oder bis zu 2 -CS-Gruppen steht,

einschließlich der möglichen stereoisomeren Formen.

2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

5 A für Alkandiyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel) oder SO<sub>2</sub> steht,

10 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

15 R<sup>2</sup> für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

20 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder Iod steht,

25 R<sup>5</sup> für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, und

30 R<sup>6</sup> für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylamino-

carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Alkenyloxy-carbonyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyl, Cyano-C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkenyl, Carboxy-C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und  
gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocycl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen ausgewählt aus bis zu 3 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoffatom und/oder einem Schwefelatom, sowie gegebenenfalls mit zusätzlich einer -SO-Gruppe, einer -SO<sub>2</sub>-Gruppe, einer -CO-Gruppe oder einer -CS-Gruppe steht.

3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass

A für Alkandiyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

Q für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder i-Propyl steht,

- 5 R<sup>2</sup> für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,
- 10 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder i-Propyl steht,
- R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor oder Brom steht,
- 15 R<sup>5</sup> für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht, und
- 20 R<sup>6</sup> für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy-carbonyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Cyano-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkenyl, Carboxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und
- 30 gegebenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Benzo-  
furyl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Benzo-  
pyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrazolyl, Benzopyrazolyl, Pyrazolinyl,  
5 Imidazolyl, Benzimidazolyl, Imidazolinyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl,  
Oxazolinyl, Isoxazolyl, Isoxazolinyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Thi-  
azolinyl, Thiadiazolyl, Triazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl  
steht.

10 4. Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch  
gekennzeichnet, dass

A für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-  
1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,1-diyl, Ethen-1,2-  
15 diyl, Propen-1,1-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl  
oder Propin-1,3-diyl steht,

Q für O (Sauerstoff) steht,

20 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Amino oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano,  
Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl  
steht,

25 R<sup>2</sup> für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gege-  
benenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substitu-  
iertes Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl steht,

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch  
Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,

30

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Cyano, Fluor oder Chlor steht,

R<sup>5</sup> für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht, und

5

R<sup>6</sup> für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Cyclopentyl-oxycarbonyl, Cyclohexyloxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl oder N-Methoxy-methylaminocarbonyl, oder durch Propenyloxycarbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind), oder durch Cyanomethyl, Cyanoethyl, Cyanopropyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, n- oder i-Propoxycarbonylmethyl, Methoxycarbonylethyl, Ethoxycarbonylethyl, n- oder i-Propoxycarbonylethyl, Cyanoethenyl, Cyanopropenyl, Carboxyethenyl, Carboxypropenyl, Methoxycarbonylethenyl, Ethoxycarbonylethenyl, n- oder i-Propoxycarbonylethenyl, Methoxycarbonylpropenyl, Ethoxycarbonylpropenyl, n- oder i-Propoxycarbonylpropenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind) substituiertes Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyra-

10

15

20

25

30

zoly, Pyrazoliny, Imidazolyl, Imidazoliny, Oxazolyl, Oxazoliny, Isoxazolyl, Isoxazoliny, Thiazolyl, Thiazoliny, Pyridiny, Pyrimidiny steht.

- 5 5. Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass

A für Methylen steht,

10  $R^1$  für Wasserstoff, Methyl oder Amino steht,

$R^2$  für Trifluormethyl steht,

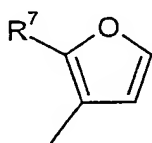
$R^3$  für Wasserstoff steht,

15

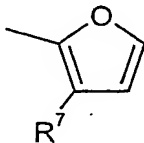
$R^4$  für Fluor steht,

$R^5$  für Chlor, Brom oder Cyano steht, und

20  $R^6$  für eine der folgenden Gruppierungen (A) bis (L) steht



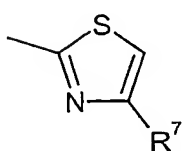
(A)



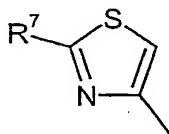
(B)



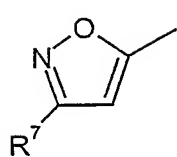
(C)



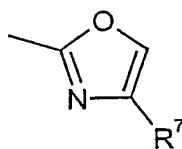
(D)



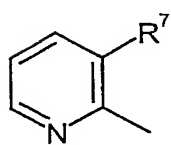
(E)



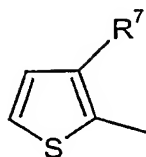
(F)



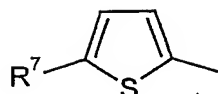
(G)



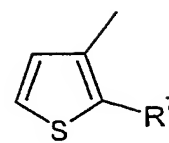
(H)



(J)



(K)



(L)

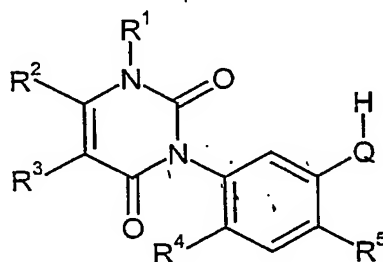
5

worin

R<sup>7</sup> für Carboxy, Carbamoyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder n- oder i-Propoxycarbonyl steht.

10

6. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (II)



(II)

15

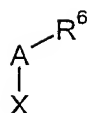
in welcher

Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (III)





(III)

in welcher

5

A und R<sup>6</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben und

10

X für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

15

und gegebenenfalls die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) umwandelt.

20

7. Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 und üblichen Streckmitteln.

8. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 oder eines Mittels gemäß Anspruch 7 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen und/oder Arthropoden.

25

9. Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Pflanzen und/oder Arthropoden, dadurch gekennzeichnet, dass man mindestens eine Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 oder ein Mittel gemäß Anspruch 7 auf

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 03/05160

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A01N43/54 A01N43/78 A01N43/80 C07D417/12 C07D413/12  
C07D409/12 C07D405/12 C07D401/12 A01N43/76

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| X          | WO 98 06706 A (DREWES MARK WILHELM ; ANDREE ROLAND (DE); BAYER AG (DE); DOLLINGER)<br>19 February 1998 (1998-02-19)<br>the whole document<br>----    | 1-9                   |
| X          | WO 96 07323 A (BAYER AG ; SANTEL HANS JOACHIM (DE); DOLLINGER MARKUS (DE); ANDREE) 14 March 1996 (1996-03-14)<br>, sentence W<br>----                | 1-9                   |
| X          | DE 44 37 197 A (BAYER AG)<br>25 April 1996 (1996-04-25)<br>the whole document<br>----  | 1-9                   |
| Y          | WO 02 34725 A (DREWES MARK WILHELM ; ANDREE ROLAND (DE); FEUCHT DIETER (DE); SCHNE)<br>2 May 2002 (2002-05-02)<br>the whole document<br>-----<br>-/- | 1-9                   |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

21 August 2003

Date of mailing of the international search report

29/08/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Von Daacke, A

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 03/05160

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| Y          | EP 1 061 075 A (ROHM & HAAS)<br>20 December 2000 (2000-12-20)<br>cited in the application<br>the whole document<br>---                               | 1-9                   |
| Y          | WO 01 77084 A (DREWES MARK WILHELM ;LINKER<br>KARL HEINZ (DE); ANDREE ROLAND (DE); F)<br>18 October 2001 (2001-10-18)<br>the whole document<br>----- | 1-9                   |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP/05160

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| WO 9806706                                | A | 19-02-1998          | DE 19632005 A1             | 12-02-1998          |
|   |   |                     | AU 718868 B2               | 20-04-2000          |
|   |   |                     | AU 3771497 A               | 06-03-1998          |
|   |   |                     | BR 9711033 A               | 17-08-1999          |
|   |   |                     | CN 1227548 A               | 01-09-1999          |
|   |   |                     | DE 59708449 D1             | 14-11-2002          |
|   |   |                     | DK 923562 T3               | 10-02-2003          |
|   |   |                     | WO 9806706 A1              | 19-02-1998          |
|   |   |                     | EP 0923562 A1              | 23-06-1999          |
|   |   |                     | ES 2181015 T3              | 16-02-2003          |
|   |   |                     | JP 2001503021 T            | 06-03-2001          |
|   |   |                     | US 6130225 A               | 10-10-2000          |
| WO 9607323                                | A | 14-03-1996          | DE 4431219 A1              | 07-03-1996          |
|   |   |                     | AU 3471595 A               | 27-03-1996          |
|   |   |                     | BR 9508690 A               | 26-05-1998          |
|   |   |                     | CN 1370406 A               | 25-09-2002          |
|   |   |                     | CN 1156394 A ,B            | 06-08-1997          |
|   |   |                     | WO 9607323 A1              | 14-03-1996          |
|   |   |                     | EP 0778732 A1              | 18-06-1997          |
|   |   |                     | JP 10505072 T              | 19-05-1998          |
|   |   |                     | US 5990044 A               | 23-11-1999          |
| DE 4437197                                | A | 25-04-1996          | DE 4437197 A1              | 25-04-1996          |
|   |   |                     | BR 9504450 A               | 20-05-1997          |
|   |   |                     | CN 1129517 A               | 28-08-1996          |
|   |   |                     | JP 8208412 A               | 13-08-1996          |
| WO 0234725                                | A | 02-05-2002          | DE 10051981 A1             | 02-05-2002          |
|   |   |                     | AU 2360402 A               | 06-05-2002          |
|   |   |                     | WO 0234725 A1              | 02-05-2002          |
|   |   |                     | EP 1330443 A1              | 30-07-2003          |
| EP 1061075                                | A | 20-12-2000          | AU 3783100 A               | 21-12-2000          |
|   |   |                     | BR 0002759 A               | 30-01-2001          |
|   |   |                     | EP 1061075 A2              | 20-12-2000          |
|   |   |                     | JP 2001031678 A            | 06-02-2001          |
|   |   |                     | US 6258751 B1              | 10-07-2001          |
| WO 0177084                                | A | 18-10-2001          | DE 10016893 A1             | 18-10-2001          |
|   |   |                     | AU 5473101 A               | 23-10-2001          |
|   |   |                     | BR 0109784 A               | 21-01-2003          |
|   |   |                     | CA 2404759 A1              | 02-10-2002          |
|   |   |                     | CN 1420873 T               | 28-05-2003          |
|   |   |                     | WO 0177084 A1              | 18-10-2001          |
|   |   |                     | EP 1272478 A1              | 08-01-2003          |
|   |   |                     | US 2002173425 A1           | 21-11-2002          |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/L 03/05160

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A01N43/54 A01N43/78 A01N43/80 C07D417/12 C07D413/12  
C07D409/12 C07D405/12 C07D401/12 A01N43/76

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| X          | WO 98 06706 A (DREWES MARK WILHELM ; ANDREE ROLAND (DE); BAYER AG (DE); DOLLINGER)<br>19. Februar 1998 (1998-02-19)<br>das ganze Dokument | 1-9                |
| X          | WO 96 07323 A (BAYER AG ; SANTEL HANS JOACHIM (DE); DOLLINGER MARKUS (DE); ANDREE) 14. März 1996 (1996-03-14)<br>, Satz W                 | 1-9                |
| X          | DE 44 37 197 A (BAYER AG)<br>25. April 1996 (1996-04-25)<br>das ganze Dokument  | 1-9                |
| Y          | WO 02 34725 A (DREWES MARK WILHELM ; ANDREE ROLAND (DE); FEUCHT DIETER (DE); SCHNE)<br>2. Mai 2002 (2002-05-02)<br>das ganze Dokument     | 1-9                |
|            | ---<br>-/-  |                    |

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*G\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

21. August 2003

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

29/08/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Von Daacke, A

# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/ISA/03/05160

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| Y          | EP 1 061 075 A (ROHM & HAAS)<br>20. Dezember 2000 (2000-12-20)<br>in der Anmeldung erwähnt<br>das ganze Dokument<br>----                              | 1-9                |
| Y          | WO 01 77084 A (DREWES MARK WILHELM ;LINKER<br>KARL HEINZ (DE); ANDREE ROLAND (DE); F)<br>18. Oktober 2001 (2001-10-18)<br>das ganze Dokument<br>----- | 1-9                |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die derselben Patentfamilie gehören

Internationaler Patentkennzeichen

PCT/EP 03/05160

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| WO 9806706 A                                       | 19-02-1998                    | DE 19632005 A1                    | 12-02-1998                    |
|  |                               | AU 718868 B2                      | 20-04-2000                    |
|  |                               | AU 3771497 A                      | 06-03-1998                    |
|  |                               | BR 9711033 A                      | 17-08-1999                    |
|  |                               | CN 1227548 A                      | 01-09-1999                    |
|  |                               | DE 59708449 D1                    | 14-11-2002                    |
|  |                               | DK 923562 T3                      | 10-02-2003                    |
|  |                               | WO 9806706 A1                     | 19-02-1998                    |
|  |                               | EP 0923562 A1                     | 23-06-1999                    |
|  |                               | ES 2181015 T3                     | 16-02-2003                    |
|  |                               | JP 2001503021 T                   | 06-03-2001                    |
|  |                               | US 6130225 A                      | 10-10-2000                    |
| WO 9607323 A                                       | 14-03-1996                    | DE 4431219 A1                     | 07-03-1996                    |
|  |                               | AU 3471595 A                      | 27-03-1996                    |
|  |                               | BR 9508690 A                      | 26-05-1998                    |
|  |                               | CN 1370406 A                      | 25-09-2002                    |
|  |                               | CN 1156394 A ,B                   | 06-08-1997                    |
|  |                               | WO 9607323 A1                     | 14-03-1996                    |
|  |                               | EP 0778732 A1                     | 18-06-1997                    |
|  |                               | JP 10505072 T                     | 19-05-1998                    |
|  |                               | US 5990044 A                      | 23-11-1999                    |
| DE 4437197 A                                       | 25-04-1996                    | DE 4437197 A1                     | 25-04-1996                    |
|  |                               | BR 9504450 A                      | 20-05-1997                    |
|  |                               | CN 1129517 A                      | 28-08-1996                    |
|  |                               | JP 8208412 A                      | 13-08-1996                    |
| WO 0234725 A                                       | 02-05-2002                    | DE 10051981 A1                    | 02-05-2002                    |
|  |                               | AU 2360402 A                      | 06-05-2002                    |
|  |                               | WO 0234725 A1                     | 02-05-2002                    |
|  |                               | EP 1330443 A1                     | 30-07-2003                    |
| EP 1061075 A                                       | 20-12-2000                    | AU 3783100 A                      | 21-12-2000                    |
|  |                               | BR 0002759 A                      | 30-01-2001                    |
|  |                               | EP 1061075 A2                     | 20-12-2000                    |
|  |                               | JP 2001031678 A                   | 06-02-2001                    |
|  |                               | US 6258751 B1                     | 10-07-2001                    |
| WO 0177084 A                                       | 18-10-2001                    | DE 10016893 A1                    | 18-10-2001                    |
|  |                               | AU 5473101 A                      | 23-10-2001                    |
|  |                               | BR 0109784 A                      | 21-01-2003                    |
|  |                               | CA 2404759 A1                     | 02-10-2002                    |
|  |                               | CN 1420873 T                      | 28-05-2003                    |
|  |                               | WO 0177084 A1                     | 18-10-2001                    |
|  |                               | EP 1272478 A1                     | 08-01-2003                    |
|  |                               | US 2002173425 A1                  | 21-11-2002                    |

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☒ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**